

Europäisches Patentamt European Patent Office Office européen des brevets



(11) EP 0 858 797 A1

(12)

DEMANDE DE BREVET EUROPEEN

(43) Date de publication: 19.08.1998 Bulletin 1998/34

(51) Int Cl.6: A61K 7/32

(21) Numéro de dépôt: 98400211.3

(22) Date de dépôt: 02.02.1998

(84) Etats contractants désignés:

AT BE CH DE DK ES FI FR GB GR IE IT LI LU MC

NL PT SE

(30) Priorité: 14.02.1997 FR 9701750

(71) Demandeur: L'OREAL 75008 Paris (FR)

(72) Inventeurs:

Forestier, Serge
 77410 Claye Souilly (FR)

 Rollat-Corvol, Isabelle 92100 Boulogne (FR)

(74) Mandataire: Andral, Christophe André Louis L'OREAL Centre de Recherche Charles Zviak Département Propriété Industrielle 90, rue du Général Roguet 92583 Clichy Cedex (FR)

(54) Composition déodorante comprenant un dendrimère

(57) La présente invention concerne une composition déodorante comprenant au moins un polymère choisi parmi les dendrimères à groupements terminaux porteurs d'une fonction amine primaire, l'utilisation de ces compositions pour l'application topique humaine et l'utilisation d'un polymère choisi parmi lesdits dendrimères comme actif déodorant.

Description

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

La présente invention concerne une composition déodorante, de préférence une composition cosmétique, comprenant au moins un polymère choisi parmi les dendriméres à groupements terminaux porteurs d'une fonction amine primaire, l'utilisation de ces compositions pour l'application topique humaine et l'utilisation d'un polymère choisi parmi lesdits dendriméres comme actif déodorant.

Elle concerne également un procédé de désodorisation mettant en oeuvre ladite composition et plus spécialement un procédé pour traiter les odeurs axillaires humaines consistant à appliquer sur la surface axillaire une quantité efficace de ladite composition.

Dans le domaine cosmétique, il est bien connu d'utiliser en application topique, des produits déodorants contenant des substances actives de type antitranspirant ou de type bactéricide pour diminuer voire supprimer les odeurs axillaires généralement désagréables.

Les substances antitranspirantes ont pour effet de limiter le flux sudoral. Elles sont généralement constituées de sels d'aluminium qui, d'une part, sont irritants pour la peau et qui, d'autre part, diminuent le flux sudoral en modifiant la physiologie cutanée, ce qui n'est pas satisfaisant.

Les substances bactéricides inhibent le développement de la flore cutanée responsable des odeurs axillaires. Parmi les produits bactéricides, le plus couramment employé est le Triclosan (5-chloro-2-(2,4-dichlorophénoxy) phénol), qui présente l'inconvénient de modifier de façon importante l'écologie de la flore cutanée, d'être inhibé par certains composés, comme par exemple les tensio-actifs non-ioniques, couramment utilisés dans la formulation de compositions cosmétiques. Le caractère insoluble du Triclosan dans l'eau ne permet pas son incorporation dans les formules essentiellement aqueuses.

Dans le but d'obtenir une efficacité à long terme, on recherche de nouveaux produits exerçant une action d'actif déodorant, c'est-à-dire des produits qui soient capables de modifier, de réduire et/ou d'ôter ou de prévenir le dévelopment des odeurs corporelles (cette définition est donnée dans l'ouvrage « Cosmetic Science and Technology Series » - 1988 / Volume 7 chap.10 - IIIc). En outre, on cherche des produits qui ne présentent pas les inconvénients des substances actives utilisées dans l'art antérieur.

On sait que certains composés basiques ont la propriété d'absorber les odeurs. C'est le cas par exemple du bicarbonate de sodium et du glycinate de zinc dont on suppose que l'action consiste à neutraliser les acides gras à chaines courtes responsables, parmi d'autres composés, des odeurs axilliaires désagréables.

On sait que certains composés poly-aminés permettent de limiter le développement des mauvaises odeurs. C'est le cas par exemple de la polyéthylène imine (polymère hyperbranché), pour laquelle on pourra se référer à la demande de brevet WO82/01993. Toutefois l'efficacité des molécules poly-aminées connues est très insuffisante, en particulier, on constate que leur action est quasi-nulle seulement quelques heures après l'application.

Après de nombreuses recherches menées sur la question, la demanderesse a découvert, de façon étonnante, que les dendriméres à groupements terminaux porteurs d'une fonction amine primaire présentent la propriété de prévenir le développement des mauvaises odeurs, sans les inconvénients des substances actives antérieurement employées dans les compositions déodorantes, et avec l'avantage d'être hydrosolubles dans des proportions intéressantes et suffisantes pour être aisément formulables, notamment dans les compositions cosmétiques à base d'eau pour l'application topique humaine. Ces compositions sont en outre non-toxiques et non-irritantes.

La présente invention a ainsi pour premier objet une nouvelle composition déodorante comprenant au moins un polymère choisi parmi les dendrimères à groupements terminaux porteurs d'une fonction amine primaire.

Elle a aussi pour objet l'utilisation desdites compositions, plus spécialement comme, ou pour la fabrication de, produits cosmétiques destinés à l'application topique humaine.

Elle a également pour objet l'utilisation d'au moins un polymère choisi parmi les dendrimères à groupements terminaux porteurs d'une fonction amine primaire comme actif déodorant, en particulier comme agent inhibiteur du développement d'odeurs.

Elle a enfin pour objet un procédé de désodorisation mettant en oeuvre ladite composition, et plus particulièrement un procédé pour traiter les odeurs axillaires humaines, consistant à appliquer sur la surface axillaire une quantilé efficace de ladite composition.

Les polymères hyperbranchés, catégorie de polymère à laquelle appartient la polyéthylèneimine, sont des contructions moléculaires ayant une structure ramifiée, en général autour d'un coeur. Leur structure est en règle générale dépourvue de symétrie : les unités de base ou monomères ayant servi à la construction du polymère hyperbranché peuvent être de natures différentes et leur répartition est irrégulière. Les branches du polymère peuvent être de natures et de longueurs différentes. Le nombre d'unités de base, ou monomères, peut être différent suivant les différentes ramifications.

ramifications.

Les polymères hyperbranchés sont généralement issus de la polycondensation d'un ou plusieurs monomères Les polymères hyperbranchés sont généralement issus de la polycondensation d'un ou plusieurs monomères ABx, A et B étant des groupements réactifs susceptibles de réagir ensemble, x étant un entier supérieur ou égal à 2, mais d'autres procédés de préparation peuvent être envisagés. Les polymères hyperbranchés se caractérisent par

leur degré de polymérisation DP = 1-b, b étant le pourcentage de fonctionnalités, non terminales, de B qui n'ont pas réagi avec un groupement A. La condensation étant non systématique, au contraire de la synthèse de dendriméres, le degré de polymérisation est inférieur à 100%. De façon habituelle, par les méthodes de synthèses connues, DP est compris entre 15 et 90%.

Les dendriméres sont des polymères et oligomères hautement ramifiés, également connus en soi, ayant une structure chimique bien définie et on dit que ce sont des polymères hyperbranchés « parfaits ». En règle générale, les dendrimères comprennent un coeur, un nombre déterminé de générations de branches, ou fuseaux, et des groupes terminaux. Les générations de fuseaux sont constituées d'unités structurelles, qui sont identiques pour une même génération de fuseaux et qui peuvent être identiques ou différentes pour des générations de fuseaux différentes. Les générations de fuseaux s'étendent radialement en une progression géométrique à partir du coeur. Les groupes terminaux d'un dendrimère de la Nième génération sont les groupes fonctionnels terminaux des fuseaux de la Nième génération ou génération terminale. De tels polymères sont décrits en particulier dans D.A.Tomalia, A.M.Naylor et W.A. Goddard III, *Angewandte Chemie*, Int.Ed.Engl.29, 138-175 (1990); C.J.Hawker et J.M.J.Frechet, *J.Am.Chem.Soc.*, 112, 7638 (1990); B.I.Voit, Acta Polymer., 46, 87-99 (1995); N.Ardoin et D.Astruc, Bull. Soc. Chim. Fr. 132, 875-909 (1995); G.R.Newkome, C.N.Moorefield, F.Vögtle, Dendritic Molecules, VCH Verlagsgesellschafl, 1996.

On peut également plus particulièrement définir les dendrimères par la formule (DI) suivante :

$$C[A_1B_1(A_2B_2(...(A_{n-1}|B_{n-1}(A_nB_n(T)r_n)r_{n-1})r_{n-2}...)r_2)r_1]s$$
(DI)

dans laquelle :

5

10

15

20

25

40

45

50

55

- C représente le coeur, relié par un nombre s de fonctionnalités à s fuseaux A₁B₁ par l'intermédiaire des groupements A₁;
- s est un nombre entier supérieur ou égal à 1 et inférieur ou égal au nombre de fonctionnalités de C;
- pour chaque fuseau (A_iB_i) (i=1, 2.....n), le groupement B_i est relié à r_i groupements A_{i+1} d'un fuseau (A_{i+1}B_{i+1});
- chaque groupement $A_i (i \ge 2)$ est relié à un seul groupement B_{i-1} du fuseau $(A_{i-1}B_{i-1})$;
 - r_i (i=1, 2....n-1) représente le nombre de fonctionnalités du groupement B_i appartenant au fuseau (A_iB_i) ; ri étant un nombre entier supérieur ou égal à 2
- l'indice i (i=1, 2.....n) est un nombre entier qui désigne la génération de chaque fuseau;
 - le fuseau de n^{ième} génération A_nB_n est chimiquement lié à un nombre r_n de groupes terminaux T; r_n étant un entier supérieur ou égal à zéro.

La définition des dendriméres donnée ci-dessus inclut des molécules à ramifications symétriques; elle inclut également des molécules à ramification non symétrique, comme par exemple les dendriméres dont les fuseaux sont des groupements lysine, dans lesquels le branchement d'une génération de fuseaux sur la précédente se fait sur les amines a et e de la lysine, ce qui cconduit à une différence dans la longueur des fuseaux des différentes ramifications.

Les polymères denses en étoiles, ou « dense star polymer », les polymères éclatés en étoile ou « starburst polymer », les dendrimères en baguette, ou « rod-shaped dendrimer », sont inclus dans la présente définition des dendrimères. Les molécules dénommées arborols et molécules en cascade entrent également dans la définition des dendrimères selon la présente invention.

Plusieurs dendrimères peuvent être associés entre eux, par une liaison covalente ou un autre type de liaison, par l'intermédiaire de leurs groupes terminaux pour donner des entités connues sous le nom de « dendrimères pontés », « agrégats de dendrimères » ou « bridged dendrimer ». De telles entités sont incluses dans la définition des dendrimères selon la présente invention.

Des dendrimères peuvent se présenter sous la forme d'un ensemble de molécules de même génération, ensembles dits monodisperses ; ils peuvent également se présenter sous la forme d'ensembles de générations différentes, dits polydisperses. La définition des dendrimères selon la présente invention inclut des ensembles monodisperses aussi bien que polydisperses de dendriméres.

L'invention concerne plus particulièrement les dendrimères à groupements terminaux porteurs d'une fonction amine primaire.

On peut se reporter aux documents suivants dans lesquéls sont décrits des dendriméres dont le groupe terminal comporte une fonction amine, le contenu de ces documents étant incorporé par référence dans la présente description : US-4,694,064; US-4,507,466; US-4,631,337; US-4,558,120; US-4,568,737; US-4,587,329; WO-A-9502008; WO-LS-4,694,064; US-4,507,466; US-4,631,337; US-4,558,120; US-4,568,737; US-4,587,329; WO-A-9502008; WO-A-9314147; EP-234408; US-4,289,872; US-4,360,646; Proc. Natl. Acad. Sci. USA, <u>85</u>, 5409-5413 (1988); WO95/02008; WO93/14147.

Les dendriméres à groupes terminaux porteurs d'une fonction amine primaire sont des polyamidoamines, comme par exemple ceux commercialisés sous la marque STARBURST PAMAM par la société DENTRITECH (copolymères séquencés d'éthylène diamine et d'acrylate de méthyle). Ils peuvent également être choisis parmi les dendrimères du type polyalkylamine, comme par exemple les polyéthylèneimines et les polypropyléneimines fabriqués par la société DSM.

Les dendriméres à groupes terminaux porteurs d'une fonction amine primaire peuvent également être constitués d'un coeur et de générations d'unités de base, monomères ou fuseaux, de toutes natures, sur lesquels un groupe terminal T porteur d'une fonction amine a été greffé.

Lorsque le dendrimère utilisé est un polyamidoamine, celui-ci est choisi de préférence parmi ceux de génération 1, génération 2, génération 3, génération 4 et génération 5 et plus particulièrement encore de génération 1.

De préférence, les fonctions amines du dendrimère sont neutralisées. Cette neutralisation permet de conférer à ces molécules à la fois une meilleure tolérance par la peau (respect du pH physiologique) et une meilleure efficacité d'inhibiteur du développement d'odeurs.

Dans les compositions déodorantes selon la présente invention, le dendrimère à groupements terminaux porteurs d'une fonction amine primaire est généralement présent dans des proportions pondérales, calculées en poids par rapport au poids total de la composition, allant environ de 0,01 à environ 10%, de préférence allant environ de 0,1 à environ 5%, et mieux encore allant environ de 0,1 à 2%.

Les compositions déodorantes de la présente invention peuvent comprendre en outre d'autres actifs déodorants classiques en plus des dendrimères définis selon l'invention.

Ces actifs déodorants peuvent être choisis par exemple parmi : Des sels hydrosolubles de zinc, comme par exemple le pyrrolidone carboxylate de zinc (plus communément appelé pidolate de zinc), le sulfate de zinc, le chlorure de zinc, le lactate de zinc, le gluconate de zinc et le phénolsulfonate de zinc ; des sels d'aluminium, comme par exemple le chlorure d'aluminium et les hydroxyhalogénures d'aluminium ; des sels de zirconium, comme par exemple des sels d'oxyde de zirconium, des sels d'hydroxyzirconyle ; des complexes de métaux comme l'aluminium ou le zirconium avec un acide aminé comme par exemple la glycine comme décrit dans US-3,792,068 ; des bactéricides.

Les compositions déodorantes de la présente invention sont formulées classiquement selon les applications auxquelles elles sont destinées.

Lorsqu'elles sont destinées à un usage cosmétique, elles sont plus particulièrement formulées dans un véhicule cosmétiquement acceptable qui peut être notamment essentiellement aqueux, et contenir des monoalcools en C₁-C₄, de préférence de l'éthanol pour accélérer l'évaporation du produit. Les monoalcools sont généralement présents en quantités allant de 15 à 50%, préférentiellement de 20 à 45% et encore plus préférentiellement de 25 à 35%.

Les compositions selon l'invention peuvent également être formulées en émulsion eau-dans-huile, huile-dans-eau, ou en émulsion triple eau-dans-huile-dans-eau, (de telles émulsions sont connues et décrites par exemple par C. FOX dans « Cosmetics and Toiletries » - november 1986 - Vol 101 - pages 101-112), auquel cas le dendrimère est présent dans la phase aqueuse de l'émulsion.

Les compositions de l'invention peuvent comprendre en outre des adjuvants cosmétiques choisis parmi les corps gras, les solvants organiques, les gélifiants, les émollients, les adoucissants, les antioxydants, les opacifiants, les stabilisants, les silicones, les agents anti-mousse, les agents hydratants, les vitamines, les parfums, les conservateurs, les tensioactifs, les charges, les séquestrants, les polymères, les propulseurs, les agents alcalinisants ou acidifiants, les colorants, les parfums, les colorants, les pigments, les agents épaississants, ou tout autre ingrédient habituellement utilisé en cosmétique.

Les tensio-actifs sont choisis de préférence parmi les tensio-actifs non-ioniques, comme par exemple les produits de condensation d'un alcool gras ou d'un acide gras avec une chaine polyalkylèneglycol.

Les corps gras peuvent être constitués par une huile ou une cire ou leur mélange, la vaseline, la paraffine, la lanoline la lanoline hydrogénée, la lanoline acétylée ; ils comprennent également les acides gras, les alcools gras tels que l'alcool laurique, cétylique, myristique, stéarique, palmitique, oléique ainsi que le 2-octyldodécanol, les esters d'acides gras tels que le monostéarate de glycérol, le monostéarate de polyéthylèneglycol, le myristate d'isopropyle, l'adipate d'isopropyle, le palmitate d'isopropyle, le palmitate d'octyle, les benzoates d'alcools gras en C₁₂-C₁₅ (Finsolv TN de FINETEX), l'alcool myristique polyoxypropyléné à 3 moles d'oxyde de propylène (WITCONOL APM de WITCO), les triglycérides d'acides gras en C₆-C₁₈ tels que les triglycérides d'acide caprylique/caprique.

Les huiles sont choisies parmi les huiles animales, végétales, minérales ou de synthèse et notamment l'huile de palme hydrogénée, l'huile de ricin hydrogénée, l'huile de vaseline, l'huile de paraffine, l'huile de Purcellin (octanoate de stéaryle), les huiles de silicone et les isoparaffines.

5

10

15

20

25

30

35

45

50

Les cires sont choisies parmi les cires animales, fossilés, végétales, minérales ou de synthèse. On peut citer notamment les cires d'abeille, les cires de Carnauba, de Candelila, de canne à sucre, du Japon, les ozokérites, la cire de Montan, les cires microcristallines, les paraffines, les cires et résines de silicone.

Les épaississants, de préférence non ioniques, peuvent être choisis parmi les gommes de guar et celluloses modifiées ou non telles que la gomme de guar hydroxypropylée, la cétylhydroxyéthylcellulose, les silices comme par exemple la Bentone Gel MiO vendue par la société NL INDUSTRIES ou la Veegum Ultra, vendue par la société PO-LYPLASTIC.

Elles peuvent comprendre des émollients, qui contribuent à une sensation douce, sèche, non-collante à l'application de la composition sur la peau. Ces émollients peuvent être choisis parmi des produits du type silicone volatile, des silicones non-volatiles et d'autres émollients non-volatils. Généralement les émollients sont présents en proportions allant de 20 à 80%, de préférence de 25 à 60% et encore plus préférentiellement de 35 à 55%.

Les silicones volatiles sont définies de façon connue comme des composés volatils à température ambiante. On peut citer parmi ces composés les silicones volatiles cycliques et linéaires du type diméthylsiloxane dont les chaines comprennent de 3 à 9 résidus siliconés. De préférence on choisit les cyclométhicones D4 ou D5.

Les silicones non-volatiles sont définies de façon connue comme des composés de pression de vapeur faible à température ambiante. Parmi ces composés sont inclus : les polyalkylsiloxanes, en particulier les polyalkylsiloxanes linéaires comme par exemple les polydiméthylsiloxanes, ou diméthicones, linéaires, commercialisés par la société Dow Corning sous le nom de « Dow Corning 200 Fluid » ; les polyalkylarylsiloxanes comme par exemple les polyméthylphénylsiloxanes, commercialisés par la société Dow Corning sous le nom de « Dow Corning 556 Fluid » ; les copolymères polyéther et siloxane, comme par exemple les diméthicone copolyols.

Parmi les émollients non-volatils utilisables dans la présente invention, on peut citer par exemple : les dérivés hydrocarbonés, les huiles minérales, les alcools gras, les esters d'alcools en C₃-C₁₈ avec des acides en C₃-C₁₈, les esters de l'acide benzoïque avec des alcools en C₁₂-C₁₃ et leurs mélanges, des polyols en C₂-C₆ choisis de préférence parmi le glycérol, le propylèneglycol ou le sorbitol, les polymères de polalkylène glycol.

Lorsque les compositions déodorantes selon l'invention sont destinées à l'usage cosmétique, elles peuvent se présenter sous forme de lotions, de crèmes ou de gels fluides distribués en spray aérosol, en flacon pompe ou en rollon, sous forme de crèmes épaisses distribuées en tubes et sous forme de sticks, et contenir à cet égard les ingrédients et propulseurs généralement utilisés dans ce type de produits et bien connus de l'homme de l'art, sous réserve qu'ils n'interfèrent pas avec les dendrimères décrits dans la présente invention.

L'invention peut aussi trouver des applications intéressantes dans le domaine des produits d'entretien et désodorisants divers (air ambiant, textiles, réfrigérateurs, vide-ordures, poubelles, litières et cages d'animaux domestiques ou gaines de ventilation des immeubles).

Des exemples concrets, mais nullement limitatifs, illustrant l'invention vont maintenant être donnés.

ESSAI 1

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

On a réalisé un test d'inhibition du développement d'odeurs sur de la sueur naturelle.

On a donc prélevé en sauna les sueurs axillaires de plusieurs sujets humains que l'on a réunies pour réaliser un échantillon de sueur. Dans chaque flacon de substance active à tester ainsi que dans un flacon témoin (sans substance) active), on introduit 1 ml de l'échantillon de sueur incubée. Puis on a introduit la substance active : x mg (x=1,10,20) de dendrimère choisis parmi les STARBURST PAMAM DENDRIMER de génération 1, 2, 3 et 5, (désignés PAMAM GEN 1 à 5) commercialisés par la société DENDRITECH, respectivement dans chacun des flacons de substance active à tester. On a ensuite procédé à une incubation des flacons à la température de 37°C. 4 à 6 évaluateurs ont ensuite senti (« sniff-test ») plusieurs fois à quelques heures d'intervalle chacun de ces flacons et noté l'intensité de l'odeur sur une échelle de 0 à 4.

Note 0 = pas d'odeur.

Note 4 = odeur forte.

Résultats:

Les résultats de ces essais sont consignés dans le tableau 1 :

Tableau 1

| | | | | Tableau T | | |
|----|-------|--|--|---------------------|----------------------|----------------------|
| | Essai | Actif | Quantité d'actif (mg d'actif par ml de sueur) | Note d'odeur à t=0h | Note d'odeur à t=20h | Note d'odeur à t=24h |
| 5 | 1.1 | PAMA | 1,8 | 0,3 | 0,3 | 0,7 |
| | | M GEN | 17,9 | 0,4 | 0,2 | 0,5 |
| | | W GLIV | 35,9 | 1 | 0,5 | 0,3 |
| | 10 | PAMA | 2 | 0,2 | 1,6 | 2,5 |
| 10 | 1.2 | | 20 | 0,7 | 0,4 | 0,5 |
| | | M GEN | 40 | 0,7 | 0,5 | 0 |
| | | 2 | | 0,3 | 0,6 | 2,7 |
| 15 | 1.3 | PAMA | 2,1 | | 1 | 2,5 |
| 15 | ŀ | M GEN | 20,9 | 0,1 | 1,7 | 1 |
| | | 3 | 41,7 | 0,9 | 0,4 | 2,3 |
| | 1.4 | PAMA | 2,3 | 0,4 | 1,3 | 2,5 |
| 20 | ' | M GEN | 22,7 | 0,3 | 2 | 2,3 |
| 20 | | 5 | 45,4 | 0,7 | 0,5 | 2 |
| | 1 | | 0 | 0,1 | 2,5 | 2,7 |
| | 1.5 | <u></u> | | | | |

Ces résultats démontrent que les dendrimères présentent une importante capacité d'inhibition du développement des odeurs de la sueur naturelle pendant au moins 20 heures et jusqu'à au moins 24 heures pour les dendrimères des 1ère et 2ème générations.

ESSAL 2

25

30

35

40

45

50

55

On a comparé la capacité des dendrimères à prévenir le développement d'odeurs par rapport à d'autres bases. On a suivi le même protocole qu'à l'exemple 1 en utilisant comme actifs déodorants :

- un dendrimère, le STARBURST PAMAM DENDRIMER de génération 1 à un taux de 1mg par ml de sueur, ce qui donne un pH de la solution à tester de 8,9;
- de la polylysine, commercialisée par la société CHISSO sous le nom de POLYLYSINE, incorporé à la sueur en quantité suffisante pour avoir un pH égal à 8,9;
- de la soude, incorporé à la sueur en quantité suffisante pour avoir un pH égal à 8,9.

Les résultats de ce test sont consignés dans le tableau 2 :

Tableau 2

| Essai Actif | | pH initial | Note d'odeur à t=0h | Note d'odeur à t=20h | Note d'odeur à t=24h | |
|-------------|-------------|------------|---------------------|----------------------|----------------------|--|
| | PAMAM GEN 1 | 8,9 | 0 | 0,8 | 1,8 | |
| 2.1 | | 8,9 | 0 | 2,6 | 2,8 | |
| 2.2 | Polylysine | | | 3,6 | 2,8 | |
| 2.3 | NaOH | 8,9 | 0 | 3,1 | 3,1 | |
| 2.4 | · | 7,8 | <u> </u> | | <u> </u> | |

Ces essais montrent la supériorité des dendrimères sur les amines connues de l'art antérieur, en particulier sur un polymère poly-aminé linéaire comme la polylysine.

ESSAL 3:

On a comparé la capacité des dendrimères à inhiber le développement des odeurs par rapport à d'autres bases. On a suivi le même protocole qu'à l'exemple 1 en utilisant comme actifs déodorants :

- un dendrimère, le STARBURST PAMAN DENDRIMER de génération 1 à un taux de 1mg par ml de sueur, ce qui donne un pH de la solution à tester de 8,8 ;
- de la polyéthylèneimine (polymère hyperbranché) commercialisée par la société BASF sous le nom de Polymin G-35, incorporé à la sueur en quantité suffisante pour avoir un pH égal à 8,8.

Les résultats de ces tests sont consignés dans le tableau 3 :

Tableau 3

| Essai | Actif | pH initial | Note d'odeur à t=14h | Note d'odeur à t=20h | Note d'odeur à t=24h |
|-------|--------------------|------------|----------------------|----------------------|----------------------|
| 3.1 | PAMAM GEN 1 | 8,8 | 0,1 | 0,8 | 0,3 |
| 3.2 | Polyéthylén eimine | 8,8 | 0,7 | 1,7 | 0,7 |
| 3.3 | <u>-</u> | 8,2 | 1,9 | 1,8 | 2,3 |

ESSAI 4:

5

10

15

20

25

30

35

40

50

55

Afin de se rapprocher des conditions d'une formulation respectant le pH physiologique cutané, un test d'efficacité des actifs a été fait à pH7.

On a donc suivi le même protocole que décrit ci-dessus sur deux sujets distincts, avec une seule évaluation à 20h, en utilisant des solutions sueur+actif neutralisées par HCL pour obtenir un pH égal à 7. On a donc testé :

- 4.1- un dendrimère, le STARBURST PAMAM DENDRIMER de génération 1 à un taux de 1mg par ml de sueur, ce qui donne un pH de la solution à tester de 8,9 ;
- 4.2- la solution 4.1 neutralisée par HCI;
- 4.3- un dendrimère, le STARBURST PAMAM DENDRIMER de génération 5 à un taux de 1mg par ml de sueur, ce qui donne un pH de la solution à tester de 8,9 ;
- 4.4- la solution 4.3 neutralisée par HCI;
- 4.5- la solution témoin : pas d'actif, pas de neutralisation

Les résultats de ces essais sont consignés dans le tableau 4 :

Tableau 4

| Essai | Actif | pH initial | Note d'odeur | Note d'odeur |
|-------|-------------|------------|--------------|--------------|
| 4.1 | PAMAM GEN 1 | 8,8 | 0,8 | 1 |
| 4.2 | PAMAM GEN 1 | 7 | 0,3 | 0,5 |
| 4.3 | PAMAM GEN 5 | 8,8 | 1 | 1,3 |
| 4.4 | PAMAM GEN 5 | 7 | 0,5 | 0,3 |
| 4.5 | - | 8,2 | 2,1 | 2,6 |

Ces résultats montrent la supériorité des dendrimères neutralisés par rapport aux dendrimères non neutralisés.

45 EXEMPLES

On a réalisé les quatre formules suivantes (deux lotions aqueuses, un stick aqueux et une émulsion huile-danseau) :

1- Lotion aqueuse:

- STARBURST PAMAM DENDRIMER de génération 1 0,5 %
- · Parfum qs
- Eau déminéralisée qsp 100

2- Lotion aqueuse:

STARBURST PAMAM DENDRIMER de génération 1 0.5 %

Parfum qs

Conservateur

qs pH7 HCI

Eau déminéralisée 5 qsp 100

3- Stick aqueux :

On a réalisé un stick aqueux déodorant de composition suivante :

6,2 % 10 Stéarate de sodium

Glycérine 15 %

Propylène glycol 20 %

11,8 % STARBURST PAMAM DENDRIMER de génération

Parfum as

qsp 100 Eau déminéralisée 15

4- Crème déodorante :

On a réalisé une crème déodorante sous la forme d'une émulsion huile dans eau de composition suivante :

Phase huileuse: 20

25

35

40

45

Mélange d'alcools cétylstéarylique et cétylstéarylique oxyéthylénés (330E) vendu sous la dénomination DEHSCONET 390 par la société TENSIA 7 %

Stéarate de glycérol (mono- et di-) vendu sous la dénomination GELEOL COPEAUX par la société GAT-**TEFOSSE**

Alcool cétylique

Polydiméthysiloxane vendu sous la dénomination SILBIONE HUILE 70 047 V300 par la société RHONE **POULENC** 1,5 %

15% Huile de vaseline

20 % Glycérine 30

Phase aqueuse:

1,8 % STARBURST PAMAM DENDRIMER de génération 1

Propylène glycol 20 %

Parfum qs

Conservateurs qs

qs pH7 HCI

qsp 100 Eau déminéralisée

Cette crème est efficace pour inhiber le développement des odeurs axillaires humaines.

Revendications

1. Composition déodorante caractérisée par le fait qu'elle comprend au moins un polymère choisi parmi les dendrimères dont les groupements terminaux sont porteurs d'une fonction amine primaire.

2. Composition selon la revendication précédente, caractérisée par le fait que le dendrimère est choisi parmi les polyamidoamines et les polyalkylamines. 50

Composition selon la revendication précédente, caractérisée par le fait que le dendrimère est choisi parmi les polyamidoamines de 1ère génération.

Composition selon l'une quelconque des revendications précédentes, caractérisée par le fait que les fonctions 55 amines des groupes terminaux du dendrimère sont neutralisées.

5. Composition selon l'une quelconque des revendications précédentes, caractérisée par le fait que le dendrimère

est présent dans des proportions allant de 0,01 à 10%, en poids par rapport au poids total de la composition.

- 6. Composition selon la revendication précédente, caractérisée par le fait que le dendrimère est présent dans des proportions allant de 0,1 à 5%, et préférentiellement de 0,1 à 2%, en poids par rapport au poids total de la composition.
- 7. Composition selon l'une quelconque des revendications précédentes, caractérisée par le fait qu'elle comprend en outre d'autres actifs déodorants.
- 8. Composition selon l'une quelconque des revendications précédentes, caractérisée par le fait qu'elle est formulée dans un véhicule essentiellement aqueux.
 - 9. Composition selon l'une quelconque des revendications 1 à 7, caractérisée par le fait qu'elle est formulée en émulsion eau-dans-huile, huile-dans-eau, ou en émulsion triple eau-dans-huile-dans-eau,
 - 10. Composition selon l'une quelconque des revendications précédentes, caractérisée par le fait qu'elle se présente sous forme d'une lotion, d'une crème ou d'un gel fluide distribué en spray aérosol, en flacon pompe ou en roll-on, sous forme d'une crème épaisse distribuée en tubes et sous forme de stick.
- 20 11. Utilisation d'une composition selon l'une quelconque des revendications précédentes comme, ou pour la fabrication de, produits cosmétiques destinés à l'application topique humaine.
 - 12. Utilisation d'au moins un polymère choisi parmi les dendriméres dont les groupements terminaux sont porteurs d'une fonction amine primaire, comme actif déodorant.
 - 13. Utilisation d'au moins un polymère choisi parmi les dendriméres dont les groupements terminaux sont porteurs d'une fonction amine primaire, comme agent inhibiteur du développement d'odeurs.
- 14. Procédé pour traiter les odeurs axillaires humaines, consistant à appliquer sur la surface axillaire une quantité
 30 efficace d'une composition selon l'une quelconque des revendications 1 à 10.

9

5

15

25

35

40

45

50



Office européen des brevets RAPPORT DE RECHERCHE EUROPEENNE EP 98 40 0211

| | CUMENTS CONSIDERES Citation du document avec indir | ation, en cas de beso | in, | Revendication concernée | CLASSEMENT DE LA DEMANDE (Int.Cl.5) | |
|--|---|---|--|--|--|---|
| atégorie Y | tes parties pertinentes EP 0 684 044 A (DSM N' * page 2, ligne 1 - l * page 3, ligne 49 - * page 4, ligne 38 - WO 96 30002 A (SANDIA * page 4, ligne 30 - | V) 29 novembrigne 7 * page 4, ligne ligne 40 * CORP) 3 octo | e 1995 9 * bre 1996 | 1,2,11 | A61K7/32 | |
| | * page 6, ligne 14 - * page 23, ligne 21 - | page /, light page 25, light | ne 2 * | | | |
| A | WO 96 14346 A (CORNEL 17 mai 1996 * page 4, ligne 24 - * page 8, ligne 21 * | page 8, ligno | e 16 * | | | |
| D,A | WO 82 01993 A (MEYER | HOLGER) 24 j | uin 1982 | | | |
| A | FR 2 368 509 A (L'OR | EAL) 19 mai 1 | 978 | | | |
| | | | | | DOMAINES TECHNIQUES RECHERCHES (IM.CL6) | : |
| | | | | | A61K | |
| · | | | | | | |
| - | e présent rapport a été établi pour to | rtes les revendications | 3 | | | |
| | Lieu de la recherche | Date d'achèvemen | it de la recherche | | Examinateur | |
| 7003) | BERLIN | 6 mai | | | McConnell, C | _ |
| BERLIN CATEGORIE DES DOCUMENTS CITE X: particulièrement pertinent à lai seul y: particulièrement pertinent en combinaiso autre document de la même catégorie A: arrière-plan technologique O: divulgation non-écrits P: document intercalaire | | | date de dépô D : cité dans la r L : cité pour d'ai | prevet anterieu it ou après cette demande utres raisons | 1, (1380 S PUDDE 4 | |